

①⑨ RÉPUBLIQUE FRANÇAISE
INSTITUT NATIONAL
DE LA PROPRIÉTÉ INDUSTRIELLE
PARIS

①① N° de publication :
(A n'utiliser que pour
le classement et les
commandes de reproduction.)

2.082.168

②① N° d'enregistrement national :
(A utiliser pour les paiements d'annuités,
les demandes de copies officielles et toutes
autres correspondances avec l'I.N.P.I.)

70.07912

①⑤ BREVET D'INVENTION

PREMIÈRE ET UNIQUE
PUBLICATION

②② Date de dépôt..... 5 mars 1970, à 15 h 53 mn.
Date de la décision de délivrance..... 15 novembre 1971.
Publication de la délivrance..... B.O.P.I. - «Listes» n. 49 du 10-12-1971.

⑤① Classification internationale (Int. Cl.).. C 07 d 51/00.

⑦① Déposant : ARIES Robert, 69, rue de la Faisanderie, Paris (16).

⑦③ Titulaire : *Idem* ⑦①

⑦④ Mandataire :

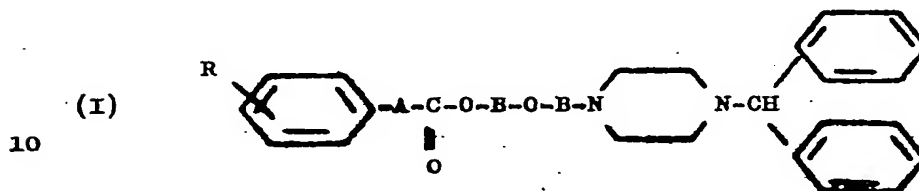
⑤④ Dérivés phénylalcanoïques de la pipérazine.

⑦② Invention de : Aries Robert.

③③ ③② ③① Priorité conventionnelle :

La présente invention vise des nouveaux esters formés entre un alcool benzhydrylpiperazinoalcoxyalcoylique et un acide phénylalcaneïque.

Ces composés sont définis par la formule générale I ci-après :



A représente une liaison directe ou un groupe hydrocarboné divalent saturé ou éthylénique en chaîne droite ou ramifiée contenant un à six atomes de carbone.

B représente un groupe hydrocarboné divalent saturé en chaîne droite ou ramifiée contenant un à cinq atomes de carbone.

A représente une ou plusieurs substitutions facultatives choisies parmi les suivantes : un ou des restes alcoyle, alcényle, cycloalcoyle, aryle, aralcoyle et/ou aralcényle et/ou un ou des halogènes et/ou un ou des groupes hydroxy, alcanoyloxy, cyano, nitro, alcoyloxy, aryloxy, aralcoyloxy, alcoylthio, arylthio, aralcoylthio, aryloxyméthyle, arylthiométhyle et/ou trifluorométhyle, les restes cycloalcoyle, aryle, aralcoyle et aralcényle pouvant eux-même porter un ou des restes alcoyle, halogènes et/ou groupes cyano, nitro, alcoyloxy, alcoylthio ou trifluorométhyle.

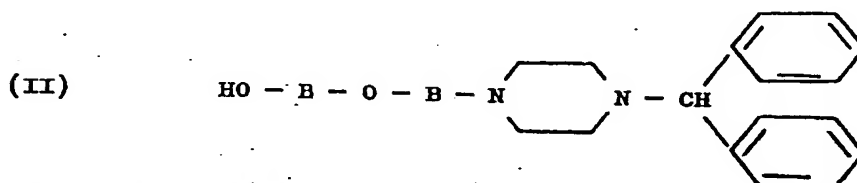
A représente une liaison directe ou un groupe hydrocarboné divalent saturé ou éthylénique en chaîne droite ou ramifiée.

Sont également visés par l'invention les sels formés entre les composés définis par la formule X et les acides organiques ou minéraux.

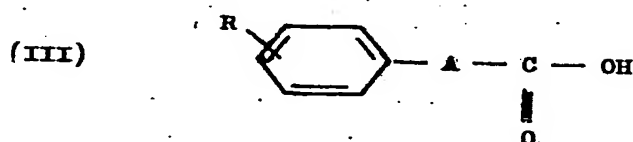
Les composés de l'invention et leurs sels possèdent des propriétés pharmacologiques très intéressantes ; ils présentent, notamment, des activités analgésiques, antipyrétiques, sympathomimétiques, antiinflammatoires, antirhumatismales, antisérotoniques et antihistaminiques.

L'invention vise les composés susdéfinis et leurs sels comme produits industriels nouveaux ; elle ne vise pas l'emploi thérapeutique de ceux-ci.

L'invention vise aussi la fabrication des composés tels qu'ils ont été précédemment définis ; les procédés préconisés par l'invention utilisent pour points de départ un benzhydryl-pipérazinoalcoxyalcanol défini par la formule II ci-après :



dans laquelle B est tel qu'il a déjà été dit, et un acide défini par la formule III ci-après ou l'anhydride ou un halogénure d'acide correspondant :



Dans cette formule A et R sont comme il a déjà été dit.

Les procédés de fabrication visés par l'invention sont tous ceux connus comme procédés généraux d'estérification lorsqu'ils sont appliqués pour la préparation des composés de l'invention.

Par exemple, suivant un procédé préconisé par l'invention, on fait réagir, le benzhydrylpipérazinoalcoxyalcanol défini par la formule II sur un acide, tel qu'il est défini par la formule III, en déplaçant l'eau de la réaction soit par entraînement azéotropique en présence ou non d'un catalyseur d'estérification, soit par l'action d'un agent deshydratant tel qu'un halogénure d'acide minéral.

Suivant un procédé préféré, on fait réagir le composé défini par la formule II sur un halogénure de l'acide à estérifier tel qu'il est défini par la formule III, l'acide halohydrrique formé dans la réaction étant éliminé comme gaz volatil ou étant fixé par une base minérale telle qu'un hydroxyde ou carbonate alcalin ou par une base organique telle qu'une amine tertiaire ou un hétérocycle azoté tertiaire. Quelques exemples de préparation sont donnés ci-après ; ces exemples sont purement illustratifs et ne limitent en rien l'invention.

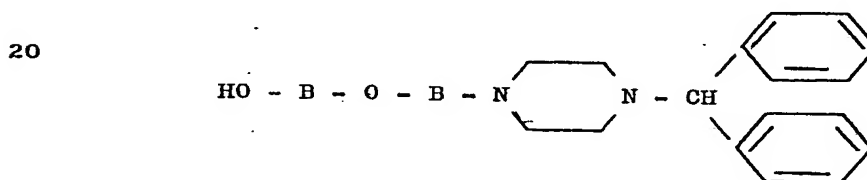
Exemple 1

(Isobutyl-4 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle

- Dans 4 litres de benzène sec, on introduit 340 grammes (1 mole) de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthanol et 101 grammes (1 mole) de triéthylamine, on agite jusqu'à dissolution puis introduit doucement et en agitant, 225 grammes (1 mole) de chlorure d'(isobutyl-4 phényl)-2 propionyle ; après addition, on porte au reflux pendant 30 minutes puis refroidit et élimine le chlorhydrate de triéthylamine par filtration ; le filtrat est évaporé sous pression réduite et le résidu est lavé au pentane puis séché dans un courant d'air sec.

Exemple 2

- En opérant comme dans l'exemple 1 et en remplaçant le \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthanol par un autre dérivé de la benzhydrylpipérazine défini par la formule générale suivante :



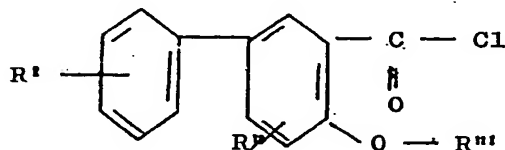
- on peut, notamment, obtenir les composés figurant dans le tableau ci-dessous :

| Composé utilisé | | Composé obtenu |
|-----------------|-----------------------------------|--|
| | -B-O-B- | |
| 30 | $-(CH_2)_3-O-(CH_2)_3-$ | (Isobutyl-4 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-3 propoxy \rceil -3 propyle |
| | $-(CH_2)_4-O-(CH_2)_4-$ | (Isobutyl-4 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-4 butoxy \rceil -4 butyle |
| 35 | $-CH_2-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)-CH_2-$ | (Isobutyl-4 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-1 isopropoxy \rceil -2 propyle |

| | |
|---|--|
| -CH(CH ₃)-CH ₂ -O-CH ₂ -CH (CH ₃)- | (Isobutyl-4 phényl)-2 propionate de [(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 propoxy] -1 isopropyle |
| -CH ₂ -CH(C ₂ H ₅)-O-CH 5 (CH ₃)-CH ₂ - | (isobutyl-4 phényl)-2 propionate de [(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-1 butyl-2 oxy]-2 butyle |

Exemple 3

En opérant comme dans l'exemple 1 et en remplaçant le
10 chlorure d'(isobutyl-4 phényl)-2 propionyle par un chlorure
défini par la formule générale suivante :



c'est-à-dire dans lequel A est une liaison directe, on peut,
notamment, obtenir les composés figurant dans le tableau
ci-dessous.

20

| Chlorure d'acide utilisé | | | Composé obtenu |
|--------------------------|----|----|--|
| R¹ | R² | R³ | |
| 25 H | H | H | hydroxy-2 phényl-5 benzoate de [(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |
| Fluoro-3 | H | H | hydroxy-2 (fluoro-3 phényl)-5 benzoate de [(benzhydryl-1 pipé- razinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |
| 30 Chloro-3 fluoro-4 | H | H | hydroxy-2 (chloro-3 fluoro-4 phényl)-5 benzoate de [(benzhy- dryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |
| 35 Chloro-2 fluoro-4 | H | H | hydroxy-2 (chloro-2 fluoro-4 phényl)-5 benzoate de [(benzhy- dryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |

40

.../...

COPY

70 07912

5

2082168

| | | | | |
|----|-----------------------|----------|---------|--|
| | Fluoro-4 méthyl-3 | H | H | hydroxy-2 (fluoro-4 méthyl-3 phényl)-5 benzoate de \lceil (benzhy- dryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 5 | difluoro- 2,4 | H | H | hydroxy-2 (difluoro-2,4 phényl)-5 benzoate de \lceil (benzhydryl-1 pipé- razinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| | Penta- fluoro | H | H | hydroxy-2 (pentafluorophényl)-5 benzoate de \lceil (benzhydryl-1 pipé- razinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 10 | Fluoro-4 méthoxy-3 | H | H | hydroxy-2 (fluoro-4 méthoxy-3 phényl)-5 benzoate de \lceil (benzhy- dryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 15 | H | H | Méthyle | méthoxy-2 phényl-5 benzoate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| | H | H | Ethyle | Ethoxy-2 phényl-5 benzoate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 20 | H | Méthyl-3 | H | hydroxy-2 méthyl-3 phényl-5 benzo- ate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl- 4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| | H | Méthyl-3 | Acétyl | acétoxy-2 méthyl-3 phényl-5 benzo- ate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl- 4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 25 | H | Méthyl-3 | Méthyl | méthoxy-2 méthyl-3 phényl-5 benzoate de \lceil (benzhydryl-1 pipéra- zinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 30 | H | Méthyl-3 | Ethyl | éthoxy-2 méthyl-3 phényl-5 benzoate de \lceil (benzhydryl-1 pipéra- zinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| | H | Ethyl-3 | H | hydroxy éthyl-3 phényl-5 benzoate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 35 | Fluoro-4 | H | Méthyl | méthoxy-2 (fluoro-4 phényl)-5 benzoate de \lceil (benzhydryl-1 pipéra- zinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |

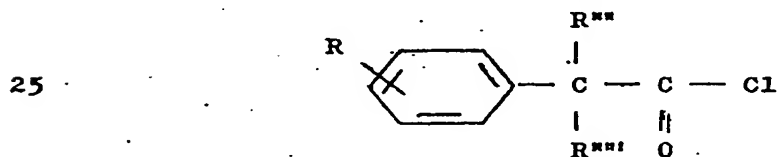
40

COPY

| | | | | |
|----|----------|----------|--------|--|
| | Fluoro-4 | H | Ethyl | éthoxy-2 (fluoro-4 phényl)-5 benzoate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 5 | Fluoro-4 | H | Acétyl | acétoxy-2 (fluoro-4 phényl)-5 benzoate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| | Fluoro-4 | Méthyl-3 | H | hydroxy-2 méthyl-3 (fluoro-4 phényl)-5 benzoate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 10 | Fluoro-4 | Méthyl-3 | Acétyl | acétoxy-2 méthyl-3 (fluoro-4 phényl)-5 benzoate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 15 | H | H | Acétyl | acétoxy-2-phényl-5-benzoate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |

Exemple 4

- 20 En opérant comme dans l'exemple 1 et en remplaçant le chlorure d'(isobutyl-4 phényl)-2 propionyle par un chlorure défini par la formule générale suivante :



- c'est-à-dire dans lequel A est un groupe $\text{R}'\text{-C-R}''$, on peut, notamment, obtenir les composés figurant dans le tableau ci-dessous.
- 30

| chlorure d'acide utilisé | | | Composé obtenu |
|--------------------------|-----------------|------------------|---|
| R | R ^{II} | R ^{III} | |
| 35 Isobutyl-4 | H | H | (isobutyl-4 phényl)acétate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| Cyclohexyl-4 | H | H | (cyclohexyl-4 phényl)acétate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 40 | | | |

| | | | |
|----------------------------------|---|--------|---|
| Phènyl-4 | H | H | (Biphènyl-4)acétate de \angle (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy)-2 éthyle |
| (chloro-4 phènyl)-4 | H | H | (chloro-4' biphènyl-4)acétate de \angle (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy)-2 éthyle |
| 5 (méthylthio-4 phènyl)-4 | H | H | (méthylthio-4' biphènyl-4)acétate de \angle (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy)-2 éthyle |
| (fluoro-4 phènyl)-4 | H | H | (fluoro-4' biphènyl-4)acétate de \angle (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy)-2 éthyle |
| 10 (trifluoro-méthyl-4 phènyl)-4 | H | H | (trifluoro-4' biphènyl-4)acétate de \angle (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy)-2 éthyle |
| 15 cyclohexyl-4 chloro-3 | H | H | (cyclohexyl-4 chloro-3 phènyl)acétate de \angle (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy)-2 éthyle |
| Butyl-4 | H | Méthyl | (n-butyl-4 phènyl)-2 propionate de \angle (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy)-2 éthyle |
| 20 Isopropyl-4 | H | Méthyl | (isopropyl-4 phènyl)-2 propionate de \angle (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy)-2 éthyle |
| Propyl-4 | H | Méthyl | (n-propyl-4 phènyl)-2 propionate de \angle (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy)-2 éthyle |
| 25 Teramyl-4 | H | Méthyl | (téramyl-4 phènyl)-2 propionate de \angle (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy)-2 éthyle |
| 30 Ethyl-4 | H | Méthyl | (éthyl-4 phènyl)-2 propionate de \angle (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy)-2 éthyle |
| Méthyl-4 | H | Méthyl | p-tolyl-2 propionate de \angle (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy)-2 éthyle |
| 35 Diéthyl-3,4 | H | Méthyl | (diéthyl-3,4 phènyl)-2 propionate de \angle (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy)-2 éthyle |
| Dipropyl-3,4 | H | Méthyl | (dipropyl-3,4 phènyl)-2 propionate de \angle (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy)-2 éthyle |
| 40 | | | |

| | | | | |
|----|----------------------------|---|--------|---|
| | Dibutyl-3,4 | H | Méthyl | (dibutyl-3,4 phènyl)-2 propionate de [(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |
| 5 | Méthyl-3 propyl-4 | H | Méthyl | (méthyl-3 propyl-4 phènyl)-2 propionate de [(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |
| | Méthyl-3 butyl-4 | H | Méthyl | (méthyl-3 butyl-4 phènyl)-2 propionate de [(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |
| 10 | Diméthyl-3,5 | H | Méthyl | (diméthyl-3,5 phènyl)-2 propionate de [(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |
| | Diéthyl-3,5 | H | Méthyl | (diéthyl-3,5 phènyl)-2 propionate de [(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |
| 15 | Diméthyl-2,4 | H | Méthyl | (diméthyl-2,4 phènyl)-2 propionate de [(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |
| | Sec-butyl-4 | H | Méthyl | (secbutyl-4 phènyl)-2 propionate de [(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |
| 20 | Terbutyl-4 | H | Méthyl | (terbutyl-4 phènyl)-2 propionate de [(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |
| 25 | Ethyl-1 propyl-4 | H | Méthyl | (éthyl-1 propyl-4 phènyl)-2 propionate de [(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |
| | (diméthyl-1,2 propyl)-4 | H | Méthyl | [(diméthyl-1,2 propyl)-4 phènyl]-2 propionate de [(benzhydryl-1 pipéra- zinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |
| 30 | (méthyl-2 butyl)-4 | H | Méthyl | [(méthyl-2 butyl)-4 phènyl]-2 propionate de [(benzhydryl-1 pipéra- zinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |
| | Méthyl-3 isopropyl-4 | H | Méthyl | (méthyl-3 isopropyl-4 phènyl)-2 propionate de [(benzhydryl-1 pipéra- zinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |
| 35 | Méthyl-2 propyl-4 | H | Méthyl | (méthyl-2 propyl-4 phènyl)-2 propionate de [(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy]-2 éthyle |

| | | | | |
|----|--------------------------------------|---|--------|--|
| | Ethyl-4 méthyl-2 | H | Méthyl | (éthyl-4-méthyl-2 phényl)-2 propionate de \square (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \square -2 éthyle |
| 5 | Ethyl-2 méthyl-4 | H | Méthyl | (éthyl-2 méthyl-4 phényl)-2 propionate de \square (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \square -2 éthyle |
| | Méthyl-4 éthyl-2 | H | Méthyl | (butyl-4 éthyl-2 phényl)-2 propionate de \square (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \square -2 éthyle |
| 10 | Triméthyl-3,4, 5 | H | Méthyl | (triméthyl-3,4,5 phényl)-2 propionate de \square (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \square -2 éthyle |
| | Triméthyl-3,4, 6 | H | Méthyl | (triméthyl-3,4,6 phényl)-2 propionate de \square (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \square -2 éthyle |
| 15 | Cyclohexyl-4 | H | Méthyl | (cyclohexyl-4 phényl)-2 propionate de \square (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \square -2 éthyle |
| 20 | Phényl-4 | H | Méthyl | (biphényl-4)-2 propionate de \square (benzhy- dryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \square -2 éthyle |
| | (chloro-4 phényl)-4 | H | Méthyl | (chloro-4: biphényl-4)-2 propionate de \square (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \square -2 éthyle |
| 25 | (fluoro-4 phényl)-4 | H | Méthyl | (fluoro-4: biphényl-4)-2 propionate de \square (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \square -2 éthyle |
| 30 | (trifluoro- méthyl-4 phényl)-4 | H | Méthyl | (trifluorométhyl-4: phényl-4)-2 propionate de \square (benzhydryl-1 pipérazi- nyl-4)-2 éthoxy \square -2 éthyle |
| | Cyclohexyl-4 | H | Méthyl | (cyclohexyl-4 chloro-3 phényl)-2 propionate de \square (benzhydryl-1 pipéra- zinyl-4)-2 éthoxy \square -2 éthyle |
| 35 | Isobutyl-4 | H | Ethyl | (isobutyl-4 phényl)-2 butyrate de \square (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \square -2 éthyle |
| | Terbutyl-4 | H | Ethyl | (terbutyl-4 phényl)-2 butyrate de \square (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \square -2 éthyle |

| | | | | |
|----|---------------------|------------------|--------|---|
| | Phènyl-4 | H | Ethyl | (biphènyl-4)-2 butyrate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 5 | Isobutyl-4 | Méthyl | Méthyl | (isobutyl-4 phènyl)-2 méthyl-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| | Terbutyl-4 | Méthyl | Méthyl | (terbutyl-4 phènyl)-2 méthyl-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 10 | Secbutyl-4 | Méthyl | Méthyl | (secbutyl-4 phènyl)-2 méthyl-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| | Isopropyl-4 | Méthyl | Méthyl | (isopropyl-4 phènyl)-2 méthyl-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 15 | Téramyl-4 | Méthyl | Méthyl | (téramyl-4 phènyl)-2 méthyl-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| | Isobutyl-4 | Méthyl | Ethyl | (isobutyl-4 phènyl)-2 méthyl-2 butyrate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 20 | Terbutyl-4 | Méthyl | Ethyl | (terbutyl-4 phènyl)-2 méthyl-2 butyrate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 25 | Phènyl-4 | Ethyl | Ethyl | (biphènyl-4)-2 éthyl-2 butyrate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| | Phènyl-4 | =CH ₂ | | (biphènyl-4)-2 acrylate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 30 | (chloro-4 phènyl)-4 | =CH ₂ | | (chloro-4' biphènyl-4)-2 acrylate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| | cyclohexyl-4 | =CH ₂ | | (cyclohexyl-4 phènyl)-2 acrylate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 35 | Méthyl-2 phènyl-4 | =CH ₂ | | (méthyl-2 biphènyl-4)-2 acrylate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle |
| 40 | | | | |

70 07912

11

2082168

Chloro-2
phényl-4

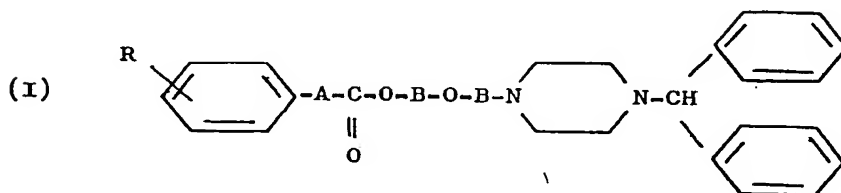
=CH₂

(chloro-2 biphényl-4)-2 acrylate
de \int (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2
éthoxy \int -2 éthyle

COPY

REVENDICATIONS

1°. Nouveaux produits industriels constitués par les composés définis par la formule générale I suivante :



dans laquelle A représente une liaison directe ou un groupe hydrocarboné divalent saturé ou éthylénique en chaîne droite ou ramifiée contenant un à six atomes de carbone.

B représente un groupe hydrocarboné divalent saturé en chaîne

15 droite ou ramifiée contenant un à cinq atomes de carbone.

R représente une ou plusieurs substitutions facultatives choisies parmi les suivantes : un ou des restes alcoyle, alcényle, cycloalcoyle, aryle, aralcoyle et /ou aralcényle et/ou un ou des halogènes et/ou un ou des groupes hydroxy, alcanoyloxy, cyano, nitro, alcoyloxy, aryloxy, aralcoyloxy, alcoylthio, arylthio, aralcoylthio, aryloxyméthyle, arylthiométhyle et/ou trifluorométhyle, les restes cycloalcoyle, aryle, aralcoyle et aralcényle pouvant eux-même porter un ou des restes alcoyle, halogènes et/ou un ou des groupes cyano, nitro, alcoyloxy, alcoylthio ou trifluorométhyle.

A représente une liaison directe ou un groupe hydrocarboné divalent saturé ou éthylénique en chaîne droite ou ramifiée.

2°. Nouveaux produits industriels conformes à la première revendication et constitués par les composés suivants :

- 30 (Isobutyl-4 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)
-3 propoxy \rceil -3 propyle
(Isobutyl-4 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)
-4 butoxy \rceil -4 butyle
(Isobutyl-4 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)
35 -1 isopropoxy \rceil -2 propyle
(Isobutyl-4 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)
-2 propoxy \rceil -1 isopropyle
(Isobutyl-4 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)
-1 butyl-2 oxy \rceil -2 butyle.

40 3°. Nouveaux produits industriels conformes à la première

revendication et constitués par les composés suivants :

- hydroxy-2 phényl-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- hydroxy-2 (fluoro-3 phényl)-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- 5 hydroxy-2 (chloro-3 fluoro-4 phényl)-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- hydroxy-2 (chloro-2 fluoro-4 phényl)-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- 10 hydroxy-2 (fluoro-4 méthyl-3 phényl)-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- hydroxy-2 (difluoro-2,4 phényl)-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- hydroxy-2 (pentafluorophényl)-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- 15 hydroxy-2 (fluoro-4 méthoxy-3 phényl)-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- méthoxy-2 phényl-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- 20 Ethoxy-2 phényl-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- hydroxy-2 méthyl-3 phényl-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- acétoxy-2 méthyl-3 phényl-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- 25 méthoxy-2 méthyl-3 phényl-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- éthoxy-2 méthyl-3 phényl-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- 30 hydroxy éthyl-3 phényl-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- méthoxy-2 (fluoro-4 phényl)-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- Ethoxy-2 (fluoro-4 phényl)-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- 35 acétoxy-2 (fluoro-4 phényl)-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle
- hydroxy-2 méthyl-3 (fluoro-4 phényl)-5 benzoate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \angle -2 éthyle

acétoxy-2 méthyl-3 (fluoro-4 phényl)-5 benzoate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle

acétoxy-2 phényl-5 benzoate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle.

- 5 4°. Nouveaux produits industriels conformes à la première revendication et constitués par les composés suivants :

(isobutyl-4 phényl)acétate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle.

(cyclohexyl-4 phényl)acétate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle

- 10 (Biphényl-4)acétate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle

(chloro-4: biphényl-4)acétate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle

- 15 (méthylthio-4: biphényl-4)acétate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle

(fluoro-4: biphényl-4)acétate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle

- 20 (trifluoro-4: biphényl-4)acétate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle

(cyclohexyl-4 chloro-3 phényl)acétate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle.

- 5°. Nouveaux produits industriels conformes à la première revendication et constitués par les composés suivants :

- 25 (n-butyl-4 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle

(isopropyl-4 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle

- 30 (n-propyl-4 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle

(téramyl-4 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle

(éthyl-4 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle

- 35 p-tolyl-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle

(diéthyl-3,4 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle

- 40 (dipropyl-3,4 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle

- (dibutyl-3,4 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
(méthyl-3 propyl-4 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
- 5 (méthyl-3 butyl-4 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
(diméthyl-3,5 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
- 10 (diéthyl-3,5 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
(diméthyl-2,4 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
(secbutyl-4 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
- 15 (terbutyl-4 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
(éthyl-1 propyl-4 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
 \angle -(diméthyl-1,2 propyl)-4 phènyl-7-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
- 20 \angle -(méthyl-2 butyl)-4 phènyl-7-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
(méthyl-3 isopropyl-4 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
- 25 (méthyl-2 propyl-4 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
(éthyl-4 méthyl-2 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
(éthyl-2 méthyl-4 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
- 30 (butyl-4 éthyl-2 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
(triméthyl-3,4,5 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
- 35 (triméthyl-2,4,6 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
(cyclohexyl-4 phènyl)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
(biphènyl-4)-2 propionate de \angle -(benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy-7-2 éthyle
- 40

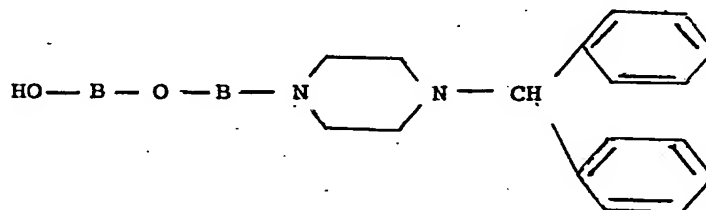
- (chloro-4' biphényl-4)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
(fluoro-4' biphényl-4)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
- 5 (trifluorométhyl-4' phényl-4)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
(cyclohexyl-4 chloro-3 phényl)-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
(isobutyl-4 phényl)-2 butyrate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
- 10 (terbutyl-4 phényl)-2 butyrate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
(biphényl-4)-2 butyrate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
- 15 6 (isobutyl-4 phényl)-2 méthyl-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
(terbutyl-4 phényl)-2 méthyl-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
(secbutyl-4 phényl)-2 méthyl-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
- 20 (isopropyl-4 phényl)-2 méthyl-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
(téramyl-4 phényl)-2 méthyl-2 propionate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
- 25 (isobutyl-4 phényl)-2 méthyl-2 butyrate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
(terbutyl-4 phényl)-2 méthyl-2 butyrate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
(biphényl-4)-2 éthyl-2 butyrate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
- 30 7 (biphényl-4)-2 acrylate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
(chloro-4' biphényl-4)-2 acrylate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
- 35 (cyclohexyl-4 phényl)-2 acrylate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
(méthyl-2 biphényl-4)-2 acrylate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle
(chloro-2 biphényl-4)-2 acrylate de \lceil (benzhydryl-1 pipérazinyl-4)-2 éthoxy \rceil -2 éthyle.
- 40

8° Nouveaux produits industriels conformes à l'une quelconque des revendications 1 à 7, constitués par les sels d'addition des composés dits dans les revendications 1 à 7 avec les acides organiques ou minéraux.

- 5 9° Procédé de fabrication de l'un quelconque des produits revendiqués dans les revendications 1 à 8, consistant dans l'action d'un alcool défini par la formule II suivante :

10

(II)

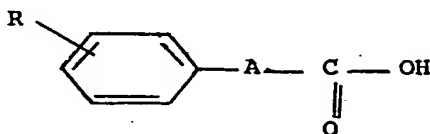


15

dans laquelle B est comme il est dit dans la première revendication, sur un acide, ou son anhydride ou halogénure, défini par la formule générale III. suivante :

20

(III)



25

dans laquelle A et R sont comme il est dit dans la première revendication.

10° Procédé conforme à la revendication 9 utilisant l'anhydride ou le chlorure d'un acide défini par la formule III en présence d'un accepteur d'acide tel qu'une base minérale ou organique.

30